

К. В. Саватеев, С. С. Борисов, Е. К. Воинков,  
Е. Н. Уломский, В. Л. Русинов, О. Н. Чупахин

Институт органического синтеза  
им. И. Я. Постовского УрО РАН  
620002, Екатеринбург, ул. Мира, 19

## 6-Аминотриазоло[1,5-а]пиримидины как предшественники 1,2,4-триазоло [5,1-б] пуринов\*

Триазоло[5,1-б]пурины являются малораспространенными структурными аналогами природных нуклеозидов и нуклеиновых оснований пуринового ряда. В то же время известные представители азолопуринов проявляют широкий спектр противовирусного действия, активность в отношении ревматоидного артрита, псориаза, болезней Альцгеймера, Паркинсона и проч. Несмотря на практическую ценность, азоло[5,1-б]пурины чрезвычайно скупо представлены в химической литературе, что обусловлено сложностью их синтеза. Нами предложен удобный путь к синтезу триазолопуринов с участием аминотриазоло[1,5-а]пиримидинов (2) в качестве доступных исходных соединений, получаемых с хорошими выходами восстановлением нитропроизводных (1).

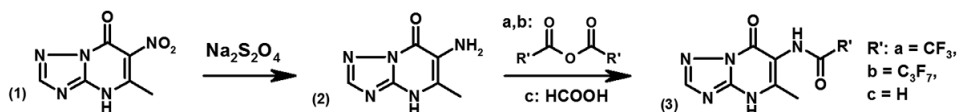
© Саватеев К. В., Борисов С. С., Воинков Е. К., Уломский Е. Н., Русинов В. Л., Чупахин О. Н., 2015

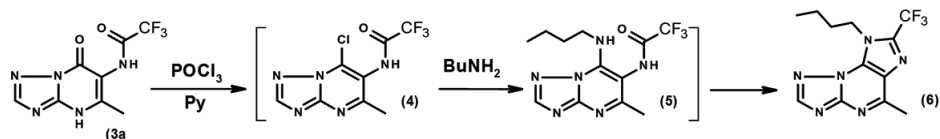
\* Работа была выполнена при поддержке гранта РФФИ 13-03-0086.

Традиционно одним из наиболее распространенных способов превращения азинов в аминоазины является хлордезоксигенирование гетероциклов с последующим аминированием хлорпроизводных [1,2]. Особенностью синтеза диаминоазинов таким методом является необходимость защиты уже имеющейся ами-

ногруппы, например, ацильным фрагментом.

Нами было использовано несколько ацильных защитных групп, с помощью соответствующих ангидридов или кислот, из которых наиболее удобной оказалась трифторацетильная защита, обеспечивающая хорошую растворимость в органических растворителях





соответствующего трифторацетильного производного.

В качестве модельного соединения для хлордезоксигенирования нами было использовано соединение 3а. Использование фосфорилхлорида и тионилхлорида в присутствии третичных аминов или ДМФА не дали удовлетворительного результата. Эффективным оказалось использование в качестве третичного амина пиридина. Полу-

ченное хлорпроизводное (4) сразу по выделении обрабатывали бутиламином с целью получения 7-аминотриазолопиримидина (5). Однако данные спектроскопии и элементного анализа показали образование триазолопурина (6).

Таким образом, нами показано, что использование 6-аминотриазолопиримидинов (2) является перспективным путем синтеза азоло[5,1-*b*]пуринов.

1. Zhang N., Ayral-Kaloustian S., Nguyen Th., Afragola J., Hernandez R., Lucas J., Gibbons J., Beyer C. Synthesis and SAR of [1,2,4]Triazolo[1,5-*a*]pyrimidines, a Class of Anticancer Agents with a Unique Mechanism of Tubulin Inhibition. *J. Med. Chem* 2007;50(2):319-327. DOI: 10.1021/jm060717i.
2. Zhao X. L., Zhao Y. F., Guo S. C., Song H. S., Wang D., Gong P. Synthesis and anti-tumor activities of novel [1,2,4]triazolo[1,5-*a*] pyrimidines. *Molecules* 2007;12(5):1136–1146. DOI: 10.3390/12051136.

Рекомендуем при цитировании данной статьи следующую ссылку: Savateev K. V., Borisov S. S., Voinkov E. K., Ulomsky E. N., Rusinov V. L., Chupakhin O. N. 6-Aminotriazolo[1,5-*a*]pyrimidines as precursors of 1,2,4-triazolo[5,1-*b*]purines // *Chimica Techno Acta*. 2015. Vol. 2. № 2. P. 127–130.